上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

产品名称：ASK1-IN-1
产品别名：GS-444217

生物活性：

Description	GS-444217 is a potent, orally available and selective ATP-competitive inhibitor of apoptosis signal-regulating kinase 1 (ASK1) with an IC50 of 2.87 nM[1].
IC_{50} & Target	ASK1
	2.87 nM (IC_{50})
In Vitro	Treatment with GS-444217 reduces ASK1 phosphorylation and prevents the phosphorylation of MKK3/6, MKK4, p38, and JNK at concentrations of 0.3 μM and above with full suppression of ASK1 activity at 1 μM. GS-444217 (1 μM) reduces ASK1 activity within 5 minutes of addition to the cultures, reaching a maximum level of inhibition by 30 minutes. Removal of GS-444217 from the cultures results in reactivation of ASK1 autophosphorylation within 10 minutes and near-complete recovery 2 hours after drug washout[1].
In Vivo	GS-444217 reduces oxidative stress (OS)-induced ASK1 signaling in kidney and inhibits acute renal tubular injury in rats. GS-444217 (30 mg/kg) inhibits activation of ASK1, p38, and JNK in rat kidney. GS-444217 has an in vivo EC50 of approximately 1.6 μM for inhibiting the ASK1 pathway in rodent kidney[1].
Solvent&Solubility	***In Vitro:***
	DMSO : 15.5 mg/mL (37.67 mM; Need ultrasonic and warming)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.4304 mL	12.1518 mL	24.3037 mL
	5 mM	0.4861 mL	2.4304 mL	4.8607 mL
	10 mM	0.2430 mL	1.2152 mL	2.4304 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

In Vivo:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。 3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.08 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Liles JT, et al. ASK1 contributes to fibrosis and dysfunction in models of kidney disease. J Clin Invest. 2018 Oct 1;128(10):4485-4500. [2]. Budas GR, et al. ASK1 Inhibition Halts Disease Progression in Preclinical Models of Pulmonary Arterial Hypertension. Am J Respir Crit Care Med. 2018 Feb 1;197(3):373-385.